

△  
*unc opening*

CLIPPEDIMAGE= JP405194179A

PAT-NO: JP405194179A

DOCUMENT-IDENTIFIER: JP 05194179 A

TITLE: SKIN COSMETIC

PUBN-DATE: August 3, 1993

INVENTOR-INFORMATION:

NAME

KUNIYOSHI, ISAO

MIMURA, KUNIO

ASSIGNEE-INFORMATION:

NAME

KANEBO LTD

COUNTRY

N/A

APPL-NO: JP04031406

APPL-DATE: January 21, 1992

INT-CL (IPC): A61K007/48;A61K007/00 ;A61K031/435 ;C07D471/22

ABSTRACT:

PURPOSE: To provide a skin cosmetic compounded with vinpocetine, having excellent aged skin improving effect such as chapped skin improving effect, cuticle improving effect, effect for promoting turn-over of cuticle layer and skin-beautifying effect.

CONSTITUTION: The objective skin cosmetic is produced by compounding preferably

0.05-2.0wt.% (based on total cosmetic) of vinpocetine of formula.

COPYRIGHT: (C)1993,JPO&Japio

(19)日本国特許庁(JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11)特許出願公開番号

特開平5-194179

(43)公開日 平成5年(1993)8月3日

(51)Int.Cl. <sup>5</sup>	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
A 6 1 K 7/48		9051-4C		
7/00		D 9165-4C		
		W 9165-4C		
31/435	ADA	7252-4C		
// C 0 7 D 471/22		8829-4C		

審査請求 未請求 請求項の数1(全 5 頁) 最終頁に続く

(21)出願番号 特願平4-31406

(22)出願日 平成4年(1992)1月21日

(71)出願人 000000952

鐘紡株式会社

東京都墨田区墨田五丁目17番4号

(72)発明者 國吉 功

神奈川県小田原市寿町5丁目12番13号

(72)発明者 三村 邦雄

神奈川県秦野市戸川875番地の4

(54)【発明の名称】 皮膚化粧料

(57)【要約】

【目的】 皮膚老化防止効果(荒肌防止効果、角質改善効果、角質層のターンオーバーを速くする効果、美肌改善効果等)に優れた皮膚化粧料を提供する。

【構成】 ビンボセチンを配合することを特徴とする皮膚化粧料。

1

## 【特許請求の範囲】

【請求項1】ビンボセチンを配合することを特徴とする皮膚化粧料。

## 【発明の詳細な説明】

## 【0001】

【産業上の利用分野】本発明は、老化皮膚改善効果（荒肌改善効果、角質改善効果、角質層のターンオーバーを速くする効果、美肌効果等）の優れた皮膚化粧料に関する。

## 【0002】

【従来の技術及び本発明が解決しようとする課題】老化皮膚とは、乾燥して滑らかなない荒れ肌で、角質細胞の剥離現象が認められ、結合組織はコラーゲン/エラスチン比が高く、しわが多い。また、老化皮膚は細胞代謝の低下により角質層のターンオーバーが遅く、したがって皮膚に老化防止効果が付与発現するとターンオーバーが遅くなると言われ、種々の皮膚組織賦活成分が研究されている。

【0003】また、本発明者は、特公昭58-26726号公報に記載のごとく、 $\gamma$ -アミノ酪酸及びその誘導体を配合してなる化粧料を提案したが、実用上に於いて皮膚に組織機能を修復または改善し、皮膚が元来保有する機能を回復して皮膚の老化防止効果に著効を示す程度に改良された皮膚化粧料を得ることは困難であった。

【0004】そこで、本発明者は、上記の事情に鑑み鋭意研究した結果、後記皮膚化粧料は老化皮膚改善効果（荒肌改善効果、角質改善効果、角質層のターンオーバーを速くする効果、美肌効果等）に優れることを確認して本発明を完成するに至った。

【0005】即ち、本発明の目的は、皮膚老化防止効果（荒肌改善効果、角質改善効果、角質層のターンオーバーを速くする効果、美肌効果等）の優れた皮膚化粧料を提供することにある。

## 【0006】

【課題を解決する手段】上述の目的は、ビンボセチンを配合することを特徴とする皮膚化粧料によって達成される。

【0007】以下、本発明の構成について詳述する。本発明に用いるビンボセチンは公知の物質であって、脳動脈硬化症の治療剤として適用されており、その化学特性

・化学名：エチル(13aS,13bS)-13a-エチル-2,3,5,6,13a,13b-ヘキサヒドロ-1H-インドロ[3,2,1-de]ピリド[3,2,1-ij][1,5]ナフチリジン-12-カルボキシレート  
・英名：Ethyl(13aS,13bS)-13a-ethyl-2,3,5,6,13a,13b-hexahydro-1H-indro[3,2,1-de]pyrido[3,2,1-ij][1,5]naphthyridine-12-carboxylate

・分子式：C<sub>22</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>

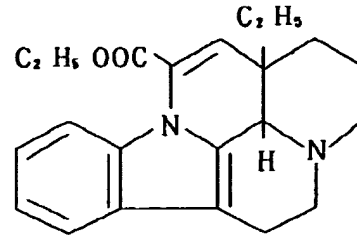
・分子量：350.46

・融点：149~153℃

2

## ・構造式：

## 【化1】



10 【0008】本発明のビンボセチンを配合してなる皮膚化粧料は、皮膚の血行を促進して皮膚機能を亢進し、皮膚が本来備えている機能を修復或いは改善して皮膚を健全な状態に保持し、特に老化皮膚に適用する場合、顕著な効果が認められる。

【0009】前記ビンボセチンの配合量は、皮膚化粧料の総量を基準として0.05~2.0重量%（以下、wt%と略記する）であり、0.05wt%未満では本発明の目的とする効果が十分でなく、一方、2.0wt%を越えてもその増加分に見合った効果の向上は得られない。

20 【0010】本発明の皮膚化粧料は、例えばローション類、乳液類、クリーム類、パック類等に適用することができる。

【0011】尚、本発明の皮膚化粧料には上記の他に色素、香料、防腐剤、界面活性剤、顔料、抗酸化剤等を本発明の目的を達成する範囲内で適宜配合することができる。

## 【0012】

【実施例】以下、実施例及び比較例に基づいて本発明を詳説する。尚、荒肌改善効果試験、角質改善効果試験、角質層のターンオーバー測定試験、官能テスト（美肌効果試験）は下記の通りである。

## 【0013】① 荒肌改善効果試験

下脚部に荒肌を有する中高年被験者20名を対象として4週間連続塗布効果を調べた。被験者の左側下脚部試験部位に1日1回約1gの試料を塗布し、試験開始前および終了後の皮膚の状態を表1の判定基準により判定した。右側下脚部は試料を塗布せず対照とした。

## 【表1】

皮膚乾燥度の判定基準	
-	正常
±	軽微乾燥、落屑無し
+	乾燥、落屑軽度
++	乾燥、落屑中等度
+++	乾燥、落屑顕著

50 【0014】試験前後の試験部位と対照部位の判定結果を比較し、皮膚乾燥度が2段階以上改善された場合（例

3  
 えば+-、++→±)を有効、1段階改善された場合をやや有効、変化がなかった場合を無効とした。試験結果は有効、やや有効となった被験者の人数で示した。

【0015】② 角質改善(角質細胞の抗剥離性増大)効果試験

前述の荒肌改善効果試験開始前および終了後の被験部皮膚にスコッチテープ(ニチバンメンディングテープ)を接着し、これを剥離した時テープに付着した角質細胞の状態を走査型電子顕微鏡によって詳細に調べ、表2の基準によって皮膚角質細胞抗剥離性を解析し、角質改善効果を求めた。

【表2】

角質改善効果(角質細胞抗剥離性増大)の判定基準	
評価点1:	スケールを認めず
2:	小スケール点在
3:	小〜中スケール顕著
4:	大スケール顕著

【0016】評価は4週間連続塗布後の試験部位の評価点と対照部位のそれとの差が2点以上の場合を有効、1点の場合をやや有効、0点の場合を無効とした。判定結果は有効、やや有効となった被験者の人数で示した。

【0017】③ 角質層のターンオーバー測定試験  
 蛍光色素のダンシルクロライドを白色ワセリン中に5重\*

\*量%配合した軟膏を作り、被験者20名の前腕部の皮膚に24時間閉塞貼布し、角質層にダンシルクロライドを浸透結合させる。その後同じ部位に1日2回(朝・夕)被験試料を塗布し、毎日ダンシルクロライドの蛍光を調べ、その蛍光が消滅するまでの日数を皮膚角質層のターンオーバーとした。

【0018】測定結果は各被験者の日数の平均値で示した。なお、通常の皮膚角質層のターンオーバーは14〜16日であるが、老化した皮膚においては18日前後にのびる。それに対して老化防止効果が現れると12日前後にまで短縮される。

【0019】④ 官能テスト(美肌効果試験)

荒肌、小じわ、乾燥肌等を訴える女子被験者(35〜55才)20人に試料を1日2回(朝・夕)連続3ヶ月塗布して3ヶ月後の効果を評価した。試験結果は、皮膚の湿潤性、平滑性、弾力性の各項目に対して、皮膚に潤いが生じた、皮膚が滑らかになった、皮膚に張りが生じたと回答した人数で示した。

【0020】実施例1〜5、比較例1、2

20 [二層型スキンローション]表3の組成のごとく二層型スキンローション基剤にビンボセチン等を表4に記載の通りに配合して各々のスキンローションを調製し、前記諸試験を実施した。

① 組成

【表3】

原 料 成 分		配合量 (wt%)
A 成 分	オリーブ油	15.0
	ミリスチン酸イソステロール	5.0
	グリセリン	0.5
	カニエーテル	3.0
	プロピレングリコール	5.0
	グリセリン	
B 成 分	メチルパラベン	0.1
	エタノール	7.0
	精製水	総量を100とする残量
C 成 分	ビンボセチン等	表4に記載

【0021】② 調製法

C成分の、ビンボセチン、 $\gamma$ -アミノ酪酸の水溶性成分をB成分中に溶解し、A、B成分を均一に溶解した後、A成分とB成分を混合撹拌分散し、次いで容器に充填する。使用時には内容物を均一に振盪分散して使用する。※50

※【0022】② 特性

各二層型スキンローションの諸試験を実施した結果を表4右欄に記載した。比較例1、2のビンボセチンを配合していないスキンローションに比較して、本発明の皮膚化粧料は諸試験に於いて良好な結果が認められた。ビン

ボセチンは、 $\gamma$ -アミノ酪酸より一段と優れた皮膚機能亢進作用を有することは明らかであった。

【0023】実施例6～9、比較例3、4

〔スキンケア〕実施例1と同様に、表5の組成にて\*

\*各々のスキンケアを調製し、諸試験を実施した結果を表4右欄に示した。

① 組成

【表4】

	有効成分 (配合量)	荒肌改善 効果(人)	角質改善 効果(人)	角質層ターン オーバー(日)	官能テスト(人) 保湿性 平滑性 弾力性
比較例	1	3	4	17	8 4 4
	2	6	7	16	6 8 7
実施例	1	4	6	17	9 6 6
	2	13	14	14	12 14 13
	3	15	16	14	15 16 17
	4	17	17	13	16 18 17
例	5	18	19	13	19 18 18
比較例	3	4	5	16	5 4 6
	4	7	8	15	8 7 7
実施例	6	15	14	14	15 13 14
	7	17	17	13	18 17 16
	8	17	18	12	19 18 18
例	9	18	19	12	19 19 18

【表5】

原料成分		配合量 (wt %)
A成分	密ロウ	2.0
	ステアリン酸	5.0
	ステアリルアルコール	5.0
	還元ラノリン	2.0
	スクアラン	20.0
	リル <sup>*</sup> タモ <sup>*</sup> ノ <sup>*</sup> ア <sup>*</sup> ルト	3.0
	リ <sup>*</sup> ル <sup>*</sup> タ <sup>*</sup> モ <sup>*</sup> ノ <sup>*</sup> ア <sup>*</sup> ルト	3.0
B成分	モ <sup>*</sup> ノ <sup>*</sup> ア <sup>*</sup> ルト	
	プロピレングリコール	5.0
C成分	メチルバラベン	0.2
	精製水	総量を100とする残量
C成分	ビンボセチン等	表4に記載

## 【0024】② 調製法

C成分のビンボセチンはB成分に、 $\gamma$ -アミノ酪酸オレイルエステルはA成分に配合して、A、B成分を各々80℃に加熱溶解した後、混合して攪拌しつつ、30℃迄冷却して各スキンクリームを調製した。

## 【0025】③ 特性

表4に示すごとく、本発明の皮膚化粧料である実施例6～9のスキンクリームは、比較例3、4と比較して諸特\*

\* 性のすべてに亘って優れていることは明らかであり、配合特性に於いても異常は認められなかった。

## 【0026】

【発明の効果】以上記載のごとく、本発明は、皮膚老化防止効果（荒肌改善効果、角質改善効果、角質層のターンオーバーを速くする効果、美肌効果等）の優れた皮膚化粧料を提供することが明らかである。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.<sup>5</sup>

(C07D 471/22

209:00

221:00)

識別記号

片内整理番号

F I

技術表示箇所